

PCT

WELTOORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro



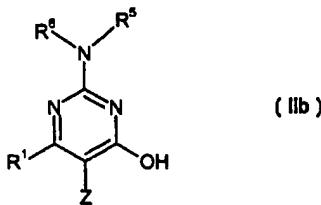
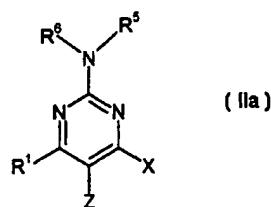
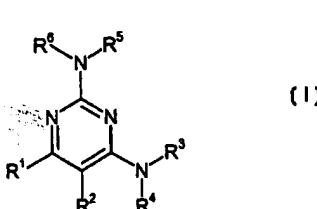
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁷ :	A2	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/63182
C07D 239/00		(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 26. Oktober 2000 (26.10.00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/03158	(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
(22) Internationales Anmeldedatum: 10. April 2000 (10.04.00)	
(30) Prioritätsdaten: 199 17 785.6 20. April 1999 (20.04.99) DE	
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).	
(72) Erfinder; und	
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): LEHR, Stefan [DE/DE]; Ricarda-Huch-Strasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). RIEBEL, Hans-Jochem [DE/DE]; In der Beek 92, D-42113 Wuppertal (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 46a, D-42799 Leichlingen (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Strasse 30 a, D-40764 Langenfeld (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). WETCHOLOWSKY, Ingo [DE/BR]; Cond. Estancia Marambaia, Rua Avare 500, CEP-13280-000 Vinhedo, SP (BR).	Veröffentlicht <i>Ohne internationalem Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.</i>
(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).	

(54) Title: 2,4-DIAMINO-PYRIMIDINE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: 2,4-DIAMINO-PYRIMIDIN-DERIVATE



(57) Abstract

The invention relates to novel 2,4-diamino-pyrimidine derivatives of the formula (I), in which R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ have the meanings defined in the description. The invention also relates to their acid addition salts and metal salt complexes and to several methods for producing said novel substances and to their use as microbicides and herbicides. Also disclosed are novel intermediates of the formulae (IIa) and (IIb), wherein R¹, R⁵, R⁶, X and Z have the meanings defined in the description, and to methods for producing them.

(57) Zusammenfassung

Neue 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalz-Komplexe, mehrere Verfahren zur Herstellung der neuen Stoffe und deren Verwendung als Mikrobizide und Herbizide. Neue Zwischenprodukte der Formeln (IIa) und (IIb), worin R¹, R³, R⁶, X und Z die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, sowie Verfahren zu deren Herstellung.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland			TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CM	Kamerun		Korea	PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

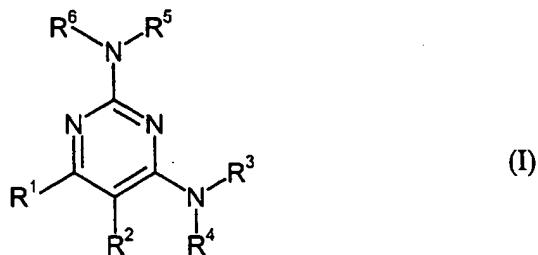
2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate

Die vorliegende Erfindung betrifft neue 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate, mehrere
5 Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung als Mikrobizide und
Herbizide.

Es ist bereits bekannt geworden, daß zahlreiche substituierte 2,4-Diamino-pyrimidine
herbizide und in manchen Fällen auch mikrobizide Eigenschaften besitzen (vgl. JP-A
10 68 563-1991, JP-A 227 978-1991 und DE-A 3 717 480). So läßt sich z.B. 2-Amino-
4-benzylamino-6-trifluormethyl-pyrimidin sowohl zur Bekämpfung von uner-
wünschten Mikroorganismen als auch von Unkräutern einsetzen. Die Wirksamkeit
dieses Stoffes ist aber vor allem bei niedrigen Aufwandmengen nicht immer be-
friedigend.

15

Es wurden nun neue 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

20

R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy,
Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methyl-
sulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl oder Alkoxy-
carbonyl steht,

25

R² für Halogen, Cyano oder Nitro steht,

15 R³ für Wasserstoff, Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

20 R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryloxyalkyl, gegebenenfalls substituiertes Heteroaryl oder gegebenenfalls substituiertes Heteroarylalkyl steht, und

25 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl stehen oder

30 R⁵ und R⁶ gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für eine -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-Gruppe stehen

oder

35 R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

40 R² für Wasserstoff steht,

45 R³ für Wasserstoff, Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

50 R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, gegebenenfalls substituiertes

- 3 -

Aryloxyalkyl, gegebenenfalls substituiertes Heteroaryl oder gegebenenfalls substituiertes Heteroarylalkyl steht,

15 R⁵ für Wasserstoff steht und

5

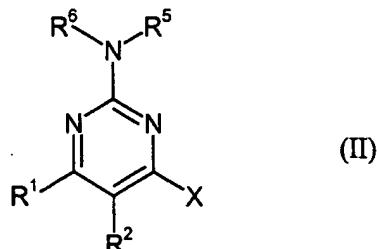
R⁶ für Methylsulfonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalz-Komplexe gefunden.

10 Weiterhin wurde gefunden, daß sich 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I) sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalz-Komplexe herstellen lassen, indem man

a) 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel

15



in welcher

20 R¹, R², R⁵ und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

20

X für Chlor oder Brom steht,

mit Aminen der Formel



25

- 4 -

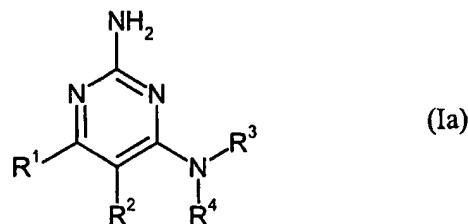
in welcher

R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

10 b) 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

15 R^1 , R^2 , R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

entweder

a) mit Halogen-Verbindungen der Formel

20



in welcher

25 R^7 für Alkyl, Acetyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

- 5 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

5

b) mit Säureanhydriden der Formel



in welcher

10

R^8 für Methyl oder Trifluormethyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

15

oder

γ) mit Isocyanaten der Formel

20



in welcher

R^9 für Alkyl steht,

25

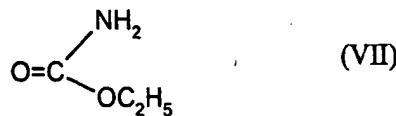
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

δ) mit Carbaminsäure-ethylester der Formel

30

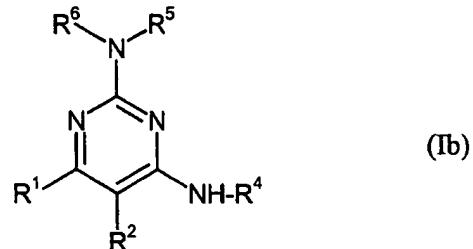
- 6 -



gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5 oder

c) 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



10 in welcher

$\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^4, \text{R}^5$ und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

entweder

15

a) mit Halogen-Verbindungen der Formel



in welcher

20

R^7 für Alkyl, Acetyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfonyl
oder Alkoxycarbonyl steht,

25 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

5 b) mit Säureanhydriden der Formel



in welcher

10 R⁸ für Methyl oder Trifluormethyl steht,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

15

15 c) mit Isocyanaten der Formel



in welcher

20

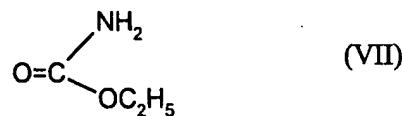
20 R⁹ für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

25

oder

25 d) mit Carbaminsäure-ethylester der Formel



gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5 und gegebenenfalls anschließend an die Verbindungen der Formel (I) eine Säure oder ein Metallsalz addiert.

10 Schließlich wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I) sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalz-Komplexe sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen sowie auch als 15 Herbizide verwendbar sind.

Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I) sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalzkomplexe eine wesentlich bessere mikrobizide und herbizide Wirksamkeit als die konstitutionell 15 ähnlichen, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung. So übertreffen sie beispielsweise das 2-Amino-4-benzylamino-6-trifluormethyl-pyrimidin bezüglich der mikrobiziden, insbesondere der fungiziden Eigenschaften.

20 Die erfindungsgemäßen 2,4-Diaminopyrimidin-Derivate sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

25 R^1 für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl oder Alkoxy-carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil steht,

30 R^2 für Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder Nitro steht,

5 R³ für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Amino, Alkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in jeder Alkylgruppe, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxy carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in der Alkoxygruppe, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder für Trifluormethylcarbonyl steht,

10 R⁴ für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R⁴ für Phenyl oder Naphthyl steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

20 R⁴ für Phenylalkyl oder Naphthylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

25 R⁴ für Phenylalkyl oder Naphthylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

30

5 R⁴ für Phenoxyalkyl oder Naphthoxyalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

10 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroaryl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroarylalkyl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, im Heteroarylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, und

20 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder für Trifluormethylcarbonyl stehen oder

25 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder für Trifluormethylcarbonyl stehen oder

30 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder für Trifluormethylcarbonyl stehen oder

R^5 und R^6 gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 oder 5 Kohlenstoffatomen oder für eine $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2$ -Gruppe stehen.

Bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel (I), in denen

5

R^1 für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl oder Alkoxy-carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil steht,

10

R^2 für Wasserstoff steht,

15

R^3 für Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Amino, Alkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in jeder Alkylgruppe, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxy carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in der Alkoxygruppe, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil oder für Trifluormethylcarbonyl steht,

20

R^4 für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, wobei jeder dieser Rest einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

25

R^4 für Phenyl oder Naphthyl steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogen-

30

alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

5 R⁴ für Phenylalkyl oder Naphthylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

10 R⁴ für Phenoxyalkyl oder Naphthoxyalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroaryl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

20 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroarylalkyl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, im Heteroarylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-

25 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroarylalkyl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, im Heteroarylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-

30 R⁴ für fünf- oder sechsgliedriges Heteroarylalkyl mit 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Schwefel und/oder Sauerstoff, im Heteroarylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei jeder Heterocyclus einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-

atomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen mit 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy,

5

R⁵ für Wasserstoff steht und

R⁶ für Methylsulfonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht.

10 Besonders bevorzugt sind 2,4-Diaminopyrimidin-Derivate der Formel (I), in denen

R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht,

15

R² für Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder Nitro steht,

R³ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, Amino, Methylamino, Ethylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Methylamino-carbonyl, Ethylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

20

R⁴ für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

25

30

5 R⁴ für Phenyl oder Naphthyl steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

10 R⁴ für Phenylalkyl oder Naphthylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R⁴ für Phenoxyalkyl oder Naphthoxyalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

20 R⁴ für Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Imidazolyl, Triazolyl, Thiazolyl, Thiadiazolyl, Thienyl oder Furyl steht, wobei diese Reste einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

25 R⁴ für Pyrrolylalkyl, Pyrazolylalkyl, Pyridylalkyl, Pyrimidinylalkyl, Imidazolyl-alkyl, Triazolylalkyl, Thiazolylalkyl, Thiadiazolylalkyl, Thienylalkyl oder für Furylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der Heterocyclus jeweils einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden

substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, und

5

R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Iso-
propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Methylsulfonyl, Acetyl,
Carboxyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Methylamino-
carbonyl, Ethylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl stehen oder

10

R⁵ und R⁶ gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 oder 5 Kohlenstoffatomen oder für
eine -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-Gruppe stehen.

15

Besonders bevorzugt sind auch 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I), in
denen

20

R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy;
Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methyl-
sulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl, Methoxycarbonyl
oder Ethoxycarbonyl steht,

R² für Wasserstoff steht,

25

R³ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-
Butyl, tert.-Butyl, Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, Amino, Methylamino,
Ethylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methylsulfonyl, Acetyl,
Carboxyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Methyl-
aminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

30

R⁴ für Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht, wobei jeder dieser Reste
einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

5 R⁴ für Phenyl oder Naphthyl steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

10 R⁴ für Phenylalkyl oder Naphthylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R⁴ für Phenoxyalkyl oder Naphthoxyalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

20 R⁴ für Phenoxyalkyl oder Naphthoxyalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der aromatische Ring jeweils einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

25 R⁴ für Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Imidazolyl, Triazolyl, Thiazolyl, Thiadiazolyl, Thienyl oder Furyl steht, wobei diese Reste einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

30 R⁴ für Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Imidazolyl, Triazolyl, Thiazolyl, Thiadiazolyl, Thienyl oder Furyl steht, wobei diese Reste einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

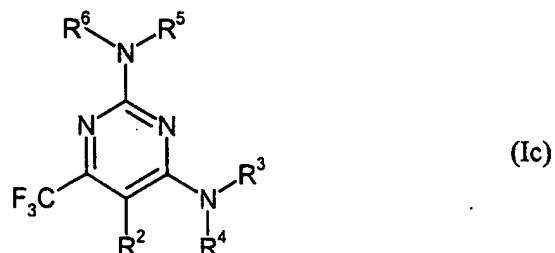
- 17 -

15 R⁴ für Pyrrolylalkyl, Pyrazolylalkyl, Pyridylalkyl, Pyrimidinylalkyl, Imidazolyl-alkyl, Triazolylalkyl, Thiazolylalkyl, Thiadiazolylalkyl, Thienylalkyl oder für Furylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht, wobei der Heterocyclus jeweils einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy,

10 R⁵ für Wasserstoff steht und

15 R⁶ für Methylsulfonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht.

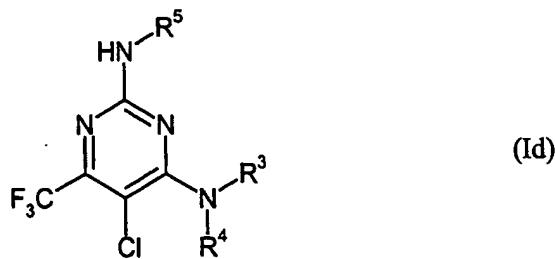
15 Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe erfindungsgemäßer Stoffe sind 2,4-Di-amino-pyrimidin-Derivate der Formel



20 in welcher R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die oben als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben.

25 Eine weitere Gruppe ganz besonders bevorzugter erfindungsgemäßer Stoffe sind 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel

- 18 -

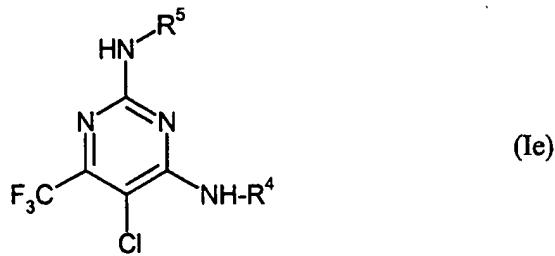


in welcher

 R^3 , R^4 und R^5 die oben als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben.

5

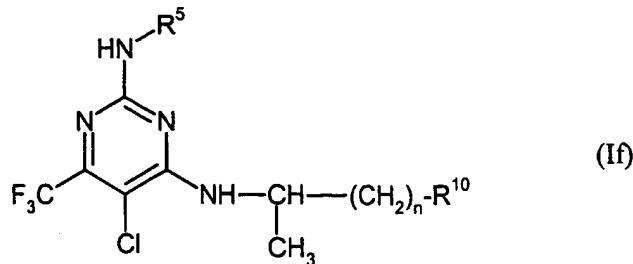
Eine weitere Gruppe ganz besonders bevorzugter erfindungsgemäßer Stoffe sind 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



10 in welcher

 R^4 und R^5 die oben als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben.

15 Eine weitere Gruppe ganz besonders bevorzugter erfindungsgemäßer Stoffe sind schließlich 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

5 R⁵ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl oder für Trifluormethylcarbonyl steht,

10 R¹⁰ für Phenyl, Naphthyl, Phenoxy oder Naphthoxy steht, wobei jeder dieser Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15 R¹⁰ für Pyrrolyl, Pyrazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Imidazolyl, Triazolyl, Thiazolyl, Thiadiazolyl, Thienyl oder Furyl steht, wobei diese Reste einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Nitro, Phenyl und/oder Phenoxy, und

20 n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht.

Die angegebenen Substituenten-Definitionen sind untereinander beliebig kombinierbar. Außerdem können auch einzelne Substituenten-Definitionen entfallen.

25 Die 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (If) enthalten ein asymmetrisch substituiertes Kohlenstoffatom. Sie können deshalb in Form von optisch aktiven Verbindungen oder als deren Gemische vorliegen.

30 Bevorzugte erfindungsgemäße Stoffe sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivaten der Formel (I), in denen R¹, R², R³,

R^4 , R^5 und R^6 diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

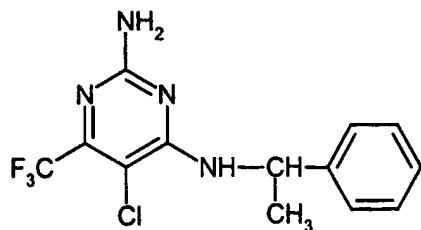
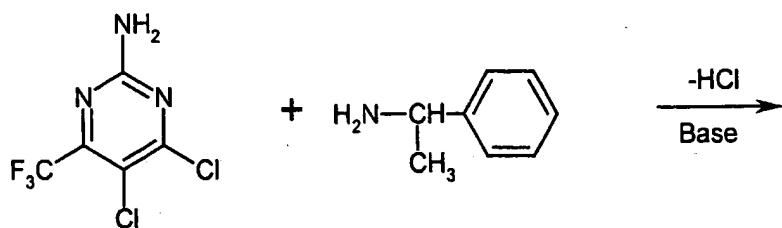
Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpeter, säure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

Bevorzugte erfindungsgemäße Stoffe sind außerdem auch Additionsprodukte aus Salzen von Metallen der II. bis IV. Haupt- und der I. und II. sowie IV. bis VIII. Nebengruppe des Periodensystems der Elemente und denjenigen 2,4-Diaminopyrimidin-Derivaten der Formel (I), in denen R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^6 diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

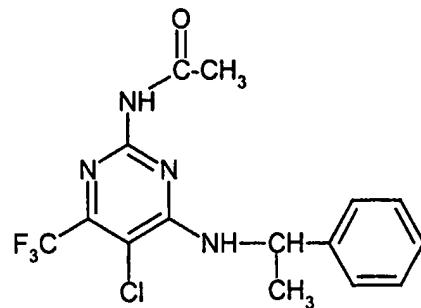
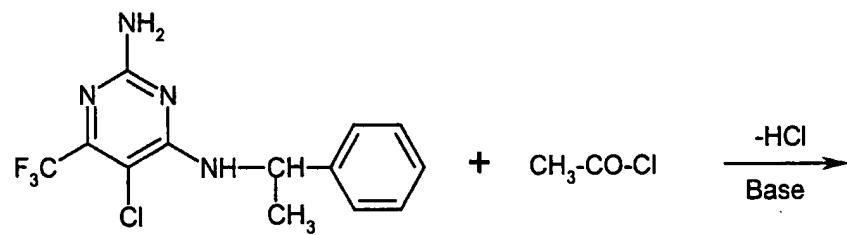
Hierbei sind Salze des Kupfers, Zinks, Mangans, Magnesiums, Zinns, Eisens und des Nickels besonders bevorzugt. Als Anionen dieser Salze kommen solche in Betracht, die sich von solchen Säuren ableiten, die zu physiologisch verträglichen Additionsprodukten führen. Besonders bevorzugte derartige Säuren sind in diesem Zusammenhang die Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure und Schwefelsäure.

25 Verwendet man 4,5-Dichlor-6-trifluormethyl-2-amino-pyrimidin und 1-Phenyl-ethylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 21 -



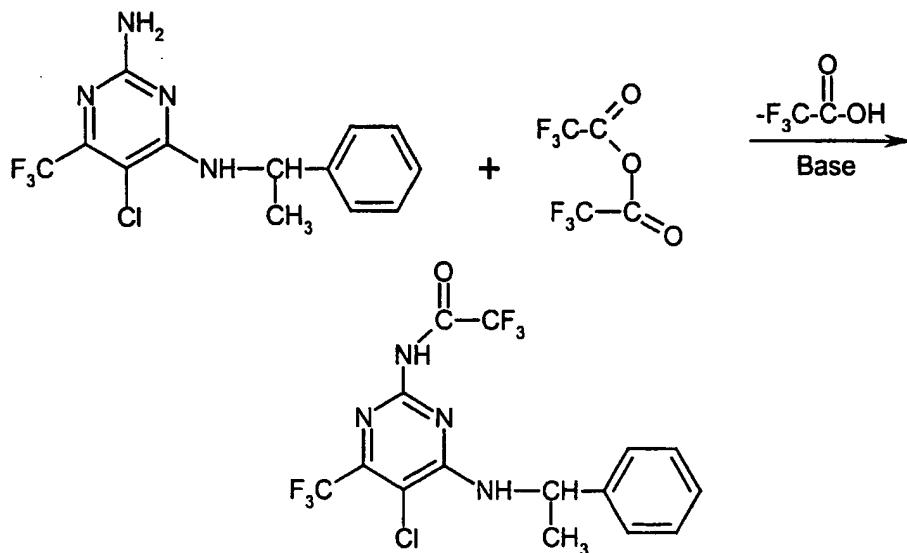
Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-
pyrimidin und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungs-
5 gemäßen Verfahrens (b, Variante α) durch das folgende Formelschema veran-
schaulicht werden.



10 Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-
pyrimidin und Trifluoressigsäureanhydrid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf

- 22 -

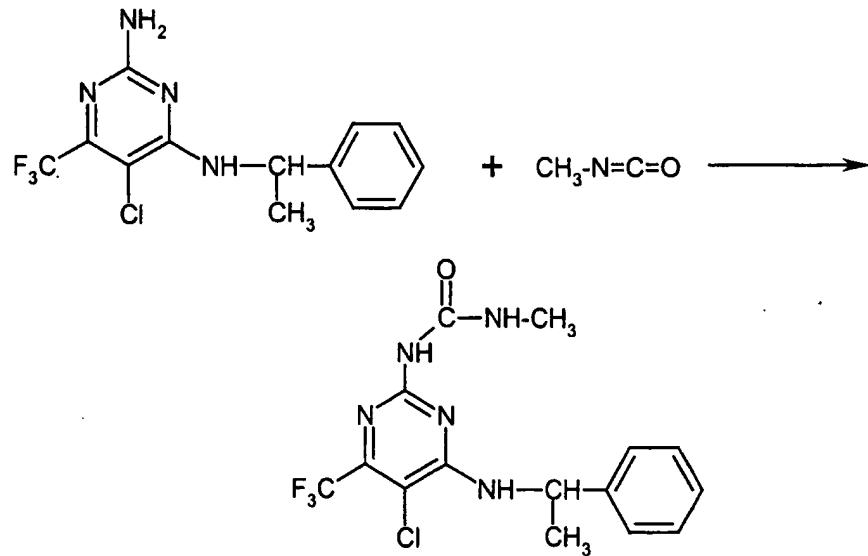
des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante β) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



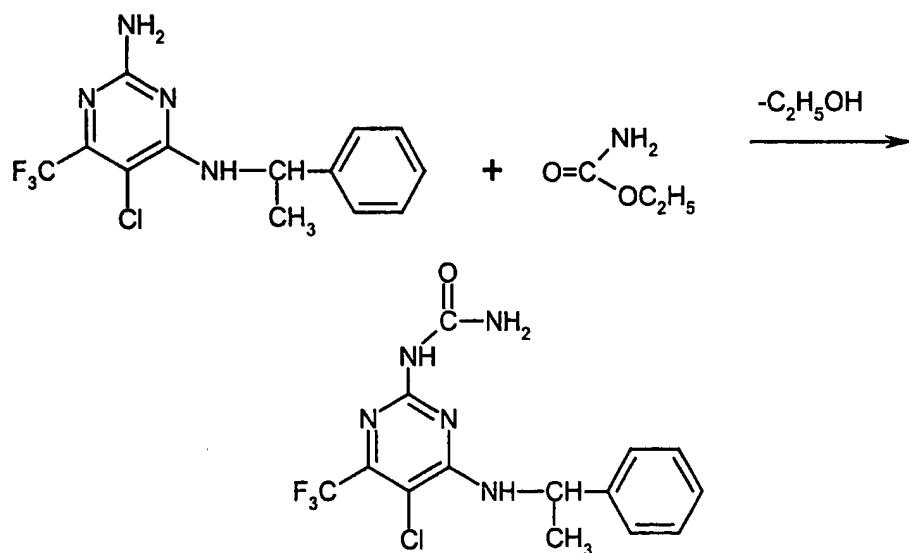
5

Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-pyrimidin und Methylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante γ) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

10

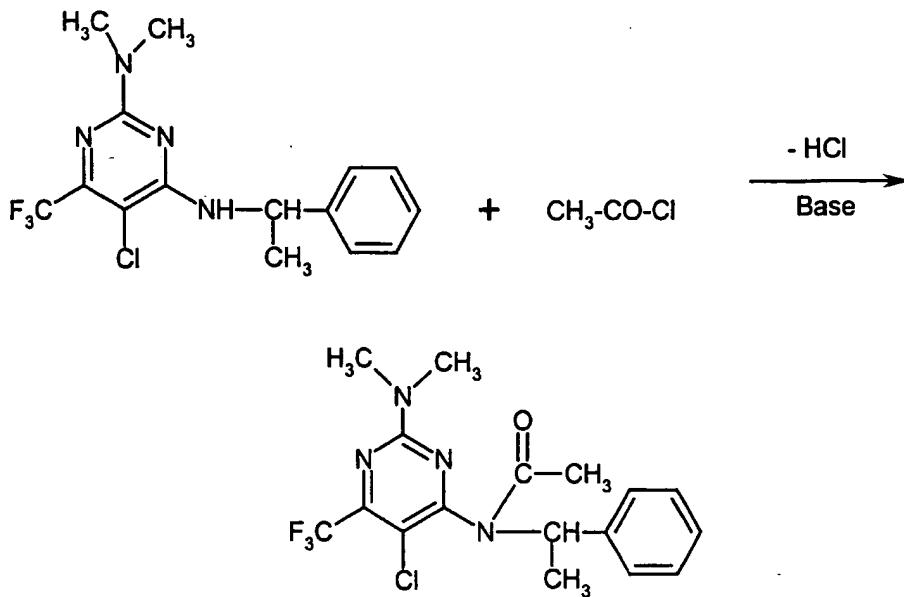


Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(1-phenyl-4-ethyl-amino)-pyrimidin und Carbaminsäure-ethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante δ) durch das folgende Formelschema 5 veranschaulicht werden.

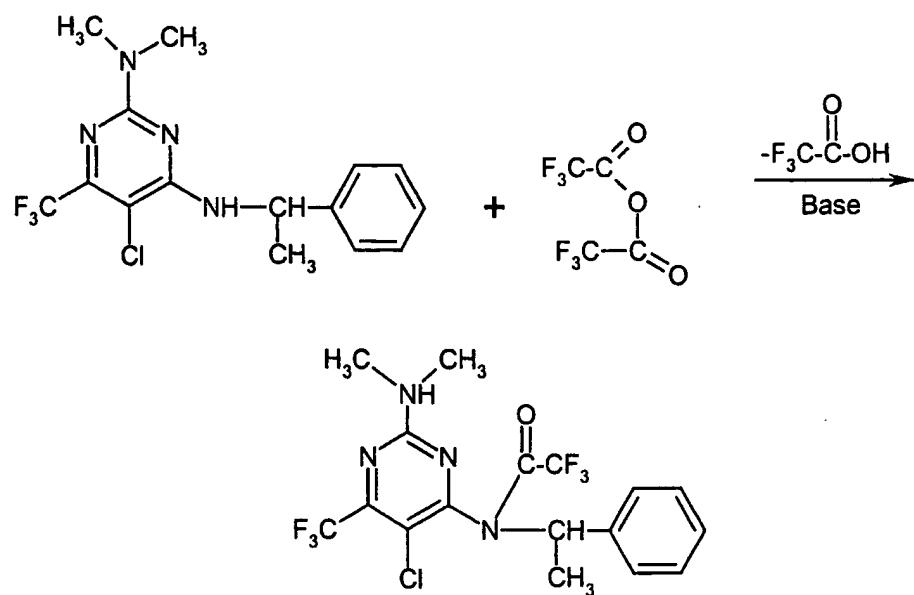


Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-dimethylamino-4-(1-phenyl-1-ethyl-amino)-pyrimidin und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c, Variante α) durch das folgende Formelschema 10 veranschaulicht werden.

- 24 -



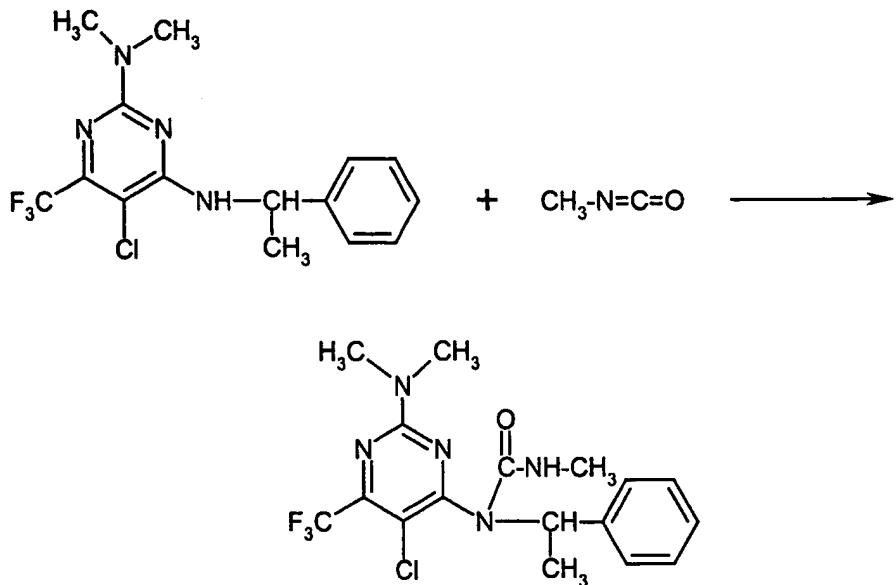
Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-dimethylamino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-pyrimidin und Trifluoressigsäureanhydrid als Ausgangsstoffe, so kann der
 5 Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c, Variante B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 25 -

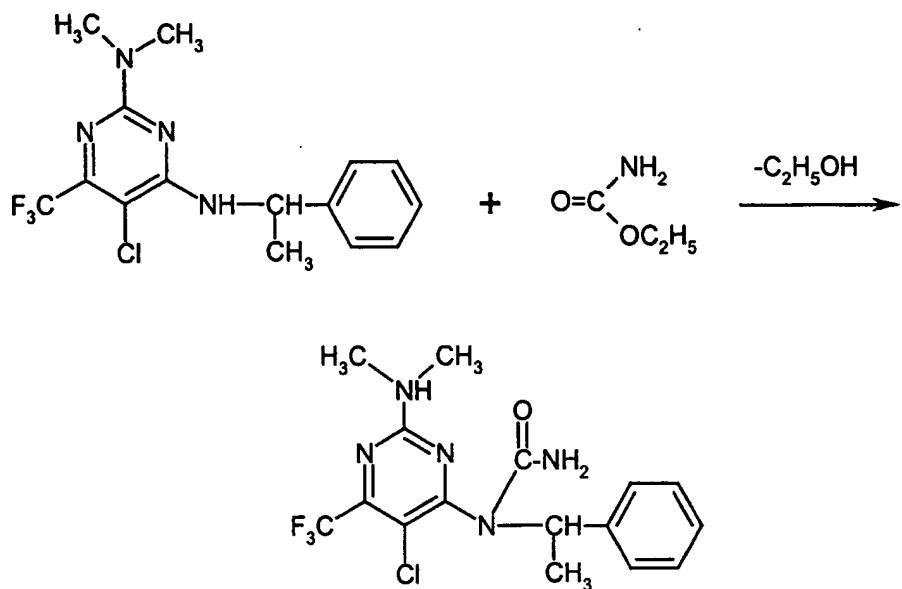
Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-dimethylamino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-pyrimidin und Methylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c, Variante γ) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

5



Verwendet man 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-dimethylamino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-pyrimidin und Carbaminsäure-ethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c, Variante δ) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

10

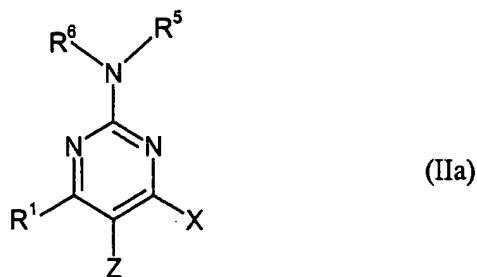


Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten 4-Halogen-2-amino-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^1 , R^2 , R^5 und R^6 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. X steht auch bevorzugt für Chlor oder Brom.

Die 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel (II) sind teilweise bekannt (vgl. J. Het. Chem. 20, 219 (1983), JP-A 68 563-1991, JP-A 227 978-1991 und DE-A 3 717 480).

Neu sind 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel

15



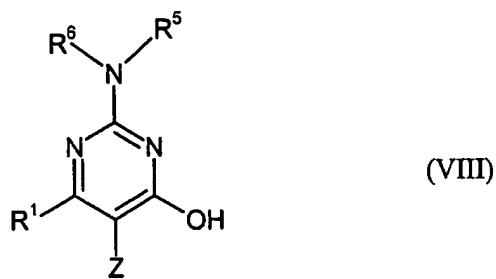
in welcher

R^1, R^5, R^6 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5 Z für Chlor oder Brom steht.

Die 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel (IIa) lassen sich herstellen, indem man

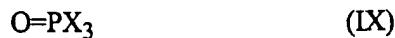
10 d) 4-Hydroxy-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

15 R^1, R^5, R^6 und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Phosphoroxy-halogeniden der Formel



20

in welcher

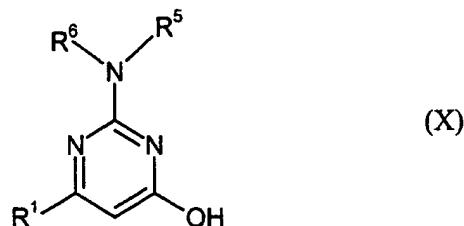
X die oben angegebene Bedeutung hat,

25 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten 4-Hydroxy-pyrimidin-Derivate sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel haben R¹, R⁵ und R⁶ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Z steht auch bevorzugt für Chlor oder Brom.

Die 4-Hydroxy-pyrimidin-Derivate der Formel (VIII) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

e) Pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

R¹, R⁵ und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Chlor oder Brom, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Pyrimidin-Derivate sind durch die Formel (X) allgemein definiert. In dieser Formel haben R¹, R⁵ und R⁶ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Die Pyrimidin-Derivate der Formel (X) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. J. Het. Chem. 20, 219 (1983)).

5 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (e) alle für derartige Umsetzungen üblichen organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform und Tetrachlorkohlenstoff, oder aliphatische Carbonsäuren, wie Essigsäure.

10 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (e) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 50°C, vorzugsweise zwischen 5°C und 40°C.

15 Bei der Durchführung des Verfahrens (e) arbeitet man ebenso wie bei der Durchführung der Verfahren (a) bis (d) vorzugsweise unter Atmosphärendruck.

20 Bei der Durchführung des Verfahrens (e) setzt man auf 1 Mol an Pyrimidin-Derivat der Formel (X) im allgemeinen eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Chlor oder Brom ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch durch Zugabe von 25 Base alkalisch stellt, in Wasser gibt, den anfallenden Feststoff absaugt, das Filtrat mit einem mit Wasser wenig mischbaren organischen Lösungsmittel extrahiert, die vereinigten organischen Phasen trocknet und einengt.

25 Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Reaktionskomponenten benötigten Phosphoroxyhalogenide sind durch die Formel (IX) definiert. Es handelt sich um die Verbindungen Phosphoroxychlorid und Phosphoroxybromid.

30 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen Solventien in Frage. Es ist aber auch möglich, in Abwesenheit zusätzlicher Verdünnungsmittel zu arbeiten.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle üblichen anorganischen oder organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natrium-
5 amid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Natriumhydrogencarbonat, ferner Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributyl-
10 amin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Di-azabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (d)
15 innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man auf 1 Mol an 4-Hydroxy-
pyrimidin-Derivat der Formel (VIII) im allgemeinen eine äquivalente Menge oder
20 auch einen Überschuß an Phosphoroxyhalogenid der Formel (IX) sowie eine an-
nähernd äquivalente Menge an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach
üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das Reak-
tionsgemisch unter verminderter Druck einengt, den Rest auf Eiswasser gibt, den
anfallenden Feststoff absaugt, wäscht und trocknet. Das erhaltene Produkt kann nach
25 üblichen Methoden von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit
werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Reaktionskom-
ponenten benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser
30 Formel haben R³ und R⁴ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zu-

sammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

5 Die Amine der Formel (III) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, ferner Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat oder Ammoniumcarbonat, oder tertiäre 10 Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder 15 Diazabicycloundecen (DBU).

20 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrol-ether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlor-methan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester 25 oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan. 30

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 5 10°C und 130°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 Mol an 4-Halogen-2-amino-pyrimidin der Formel (II) im allgemeinen eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Amin der Formel (III) sowie eine äquivalente 10 Menge an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das Reaktionsgemisch einengt, den verbleibenden Rückstand mit Wasser verröhrt, den entstehenden Feststoff absaugt, wäscht und nach üblichen Methoden, wie Umkristallisation und/oder Chromatographie, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben R¹, R², R³ und R⁴ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste genannt wurden.

20 Bei den 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivaten der Formel (Ia) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe, die sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen lassen.

25 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante α) als Reaktionskomponenten benötigten Halogen-Verbindungen sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel steht

15 R⁷ vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Acetyl, Trifluor-methylcarbonyl, Methylsulfonyl der Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-
10 atomen im Alkoxyteil,

20 5 R⁷ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Acetyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfonyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl.

25 Die Halogen-Verbindungen der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach
10 bekannten Verfahren herstellen.

30 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Ver-
fahrens (b, Variante a) alle üblichen anorganischen und organischen Basen in
Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Säurebindemittel, die schon
15 im Zusammenhang mit der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als
bevorzugt genannt wurden.

35 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Ver-
fahrens (b, Variante a) alle üblichen inerten organischen Solventien in Frage.
20 Vorzugsweise verwendbar sind alle diejenigen Lösungsmittel, die bereits im Zu-
sammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als be-
vorzugt genannt wurden.

40 Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsge-
mäßen Verfahrens (b, Variante a) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert
25 werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C,
vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

45 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante a) setzt man
30 auf 1 Mol an 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivat der Formel (Ia) im allgemeinen eine
äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Halogen-Verbindung der Formel

(IV) sowie eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch mit Wasser verdünnt, die organische Phase abtrennt, wäscht, trocknet und unter verminderter Druck einengt. Es ist jedoch auch möglich, das Reaktionsgemisch zunächst einzulagern, dann mit einem mit Wasser wenig mischbaren organischen Lösungsmittel zu versetzen, die entstehende organische Phase zu waschen und nach dem Trocknen unter verminderter Druck einzulagern. Das entstehende Produkt kann gegebenenfalls nach üblichen Methoden von eventuell noch enthaltenen Verunreinigungen befreit werden.

10 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante B) als Reaktionskomponenten benötigten Säureanhydride sind durch die Formel (V) definiert. Die betreffenden Verbindungen sind bekannt.

15 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante B) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht.

20 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante B) alle für derartige Umsetzungen üblichen inerten organischen Solventien in Frage.

25 Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante B) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante B) setzt man auf 1 Mol an 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivat der Formel (Ia) im allgemeinen 1 bis 4 Mol an Säureanhydrid der Formel (V) sowie eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen

Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch einengt, mit Wasser versetzt, dann mit einem mit Wasser wenig mischbaren organischen Solvens extrahiert und die vereinigten organischen Phasen nach dem Trocknen unter verminderter Druck einengt. Das entstehende Produkt kann gegebenenfalls nach 5 üblichen Methoden von noch anhaftenden Verunreinigungen befreit werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante γ) als Reaktionskomponenten benötigten Isocyanate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel steht R⁹ vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoff-10 atomen, besonders bevorzugt für Methyl oder Ethyl.

Die Isocyanate der Formel (VI) sind bekannt.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante γ) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten 15 organischen Solventien in Betracht.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante γ) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert 20 werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 60°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante γ) setzt man auf 1 Mol an 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivat der Formel (Ia) im allgemeinen eine 25 äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Isocyanat der Formel (VI) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Der bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante δ) als Reaktionskomponente benötigte Carbaminsäure-ethylester der Formel (VII) ist 30 bekannt.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante δ) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol oder Isopropanol.

5

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante δ) in einem bestimmten Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 30°C und 90°C.

10

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b, Variante δ) setzt man auf 1 Mol an 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivat der Formel (Ia) im allgemeinen eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuß an Carbaminsäure-ethylester der Formel (VII) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

15

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate sind durch die Formel (Ib) allgemein definiert. In dieser Formel haben R¹, R², R⁴, R⁵ und R⁶ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) vorzugsweise für diese Reste genannt wurden.

20

Bei den 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivaten der Formel (Ib) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe, die sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen lassen.

25

Als Reaktionskomponenten dienen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) nach den Varianten (α, β, γ und δ) alle diejenigen Komponenten, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) genannt wurden.

30

Außerdem sind bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) nach den Varianten (α , β , γ und δ) auch die Reaktionsbedingungen identisch mit denjenigen, die bei der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) erwähnt wurden.

5

Die erfindungsgemäßen 2,4-Diaminopyrimidin-Derivate der Formel (I) können in Säureadditions-Salze oder Metallsalz-Komplexe überführt werden.

10 Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen der Verbindungen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte Säuren genannt wurden.

15 Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, z.B. Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

20

Zur Herstellung von Metallsalz-Komplexen der Verbindungen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Salze von Metallen in Frage, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Metallsalz-Komplexe als bevorzugte Metallsalze genannt wurden.

25

Die Metallsalz-Komplexe der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Verfahren erhalten werden, so z.B. durch Lösen des Metallsalzes in Alkohol, z. B. Ethanol und Hinzufügen zu Verbindungen der Formel (I). Man kann Metallsalz-Komplexe in bekannter Weise, z. B. durch Abfiltrieren, isolieren und gegebenenfalls durch Umkristallisation reinigen.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

5 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

10 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

15 Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
20 Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
25 Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
30 Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*

(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);
Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;

5 Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;

10 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

15 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

20 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich insbesondere zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie Erysiphe-, Puccinia- und Leptosphaeria-Arten. Außerdem lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe sehr gut gegen Pyricularia oryzae an Reis einsetzen.

30 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Erntertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

5 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und 10 Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien 15 vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

20 Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

25 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:
Alternaria, wie Alternaria tenuis,
Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
Coniophora, wie Coniophora puetana,
30 Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,

5 Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
 Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
 Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
 Escherichia, wie *Escherichia coli*,
 Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
 Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe besitzen auch eine herbizide Wirksamkeit und können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

15 Die zur Unkrautbekämpfung notwendigen Dosierungen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe liegen zwischen 0,001 und 10 kg/ha, vorzugsweise zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

25 Dikotyle Unkräuter der Gattungen: *Sinapis*, *Lepidium*, *Galium*, *Stellaria*, *Matricaria*, *Anthemis*, *Galinsoga*, *Chenopodium*, *Urtica*, *Senecio*, *Amaranthus*, *Portulaca*, *Xanthium*, *Convolvulus*, *Ipomoea*, *Polygonum*, *Sesbania*, *Ambrosia*, *Cirsium*, *Carduus*, *Sonchus*, *Solanum*, *Rorippa*, *Rotola*, *Lindernia*, *Lamium*, *Veronica*, *Abutilon*, *Emex*, *Datura*, *Viola*, *Galeopsis*, *Papaver*, *Centaurea*, *Trifolium*, *Ranunculus*, *Taraxacum*.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

5 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

10 Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

15 Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

20 Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

25 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfaktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere 5 Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurenährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, 10 Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die 20 Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

25 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Aroxystrobin,
Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,
30 Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chlo-

ropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M,

5 Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Edifenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fenthydroxyd, Ferbam,

10 Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

15 Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadintriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid,

20 Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

25 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenoxy,

30 Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Quinconazol, Quintozan (PCNB), Quinoxifen,

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,
Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,
Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,
Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid,
5 Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
Uniconazol,
Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
Dagger G,
10 OK-8705,
OK-8801,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
15 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
(E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
20 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester
1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
25 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-
30 carboxanilid,
2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,

2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
5 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- β -D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
2-Aminobutan,
2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
10 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
2-Phenylphenol(OPP),
3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
15 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
3-[2-(4-Chlorophenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
20 8-Hydroxychinolinsulfat,
9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
25 hydrochlorid,
Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,
Kaliumhydrogencarbonat,
Methantetrathiol-Natriumsalz,
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
30 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,

N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
5 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
10 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinylloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
15 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

Bakterizide:

20 Bromopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,
Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

25 Abamectin, Acephat, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin, Bacillus thuringiensis, 4-Bromo-2-(4-chlorophenyl)-1-(ethoxymethyl)-5-(trifluoromethyl)-1H-pyrrole-3-carbonitrile, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Betacyfluthrin, Bifenthrin, BPMC, Brofenprox, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloetho-
carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos,
N-[(6-Chloro-3-pyridinyl)-methyl]-N'-cyano-N-methyl-ethanimidamide, Chlor-
pyrifos, Chlorpyrifos M, Cis-Resmethrin, Clocythrin, Clofentezin, Cyanophos,
5 Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazin,
Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,
Dichlofenthion, Dichlorvos, Diclidophos, Dicrotophos, Diethion, Diflubenzuron, Dime-
thoat,
Dimethylvinphos, Dioxathion, Disulfoton,
10 Emamectin, Esfenvalerat, Ethiofencarb, Ethion, Ethofenprox, Ethoprophos,
Etriphos,
Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatinoxid, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb,
Fenoxy carb, Fenpropothrin, Fenpyrad, Fenpyroxim, Fenthion, Fenvalerate,
Fipronil, Fluazuron, Flucycloxuron, Flucythrin, Flufenoxuron, Flufenprox, Flu-
15 valinate, Fonophos, Formothion, Fosthiazat, Fubfenprox, Furathiocarb,
HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox,
Imidacloprid, Isazophos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,
Lambda-cyhalothrin, Lufenuron,
Malathion, Mecarbam, Mevinphos, Mesulfenphos, Metaldehyd, Methacrifos, Metha-
20 midophos, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Milbemectin, Mono-
crotophos, Moxidectin,
Naled, NC 184, Nitrophenyl,
Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M, Oxydeprofos,
Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthroate, Phorat, Phosalon, Phosmet, Phos-
25 phamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos M, Pirimiphos A, Profenophos, Prom-
carb, Propaphos, Propoxur, Prothiophos, Prothoate, Pyrimetozin, Pyrachlophos, Pyri-
daphenthion, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
Quinalphos,
Salithion, Sebufos, Silafluofen, Sulfotep, Sulprofos,
30 Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin,
Temephos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiacloprid, Thiafenox,

Thiametoxam, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thionazin, Thuringiensin, Tralomethrin, Triarathen, Triazophos, Triazuron, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, XMC, Xylolcarb, Zetamethrin.

5

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

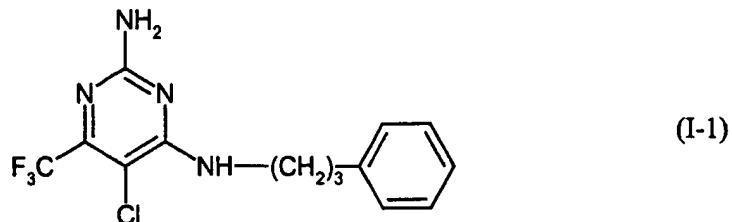
Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Die zum Schutz technischer Materialien verwendeten Mittel enthalten die Wirkstoffe im allgemeinen in einer Menge von 1 bis 95 Gewichts-%, bevorzugt von 10 bis 30 75 Gewichts-%.

Die Anwendungskonzentrationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe richten sich nach der Art und dem Vorkommen der zu bekämpfenden Mikroorganismen sowie nach der Zusammensetzung des zu schützenden Materials. Die optimale Einsatzmenge kann durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen liegen die Anwendungskonzentrationen im Bereich von 0,001 bis 5 Gewichts-%, vorzugsweise von 0,05 bis 5 Gewichts-% bezogen auf das zu schützende Material.

Die Wirksamkeit und das Wirkungsspektrum der erfindungsgemäß im Materialschutz zu verwendenden Wirkstoffe bzw. der daraus herstellbaren Mittel, Konzentrate oder ganz allgemein Formulierungen kann erhöht werden, wenn gegebenenfalls weitere antimikrobiell wirksame Verbindungen, Fungizide, Bakterizide, Herbizide, Insektizide oder andere Wirkstoffe zur Vergrößerung des Wirkungsspektrums oder Erzielung besonderer Effekte wie z.B. dem zusätzlichen Schutz vor Insekten zugesetzt werden. Diese Mischungen können ein breiteres Wirkungsspektrum besitzen als die erfindungsgemäßen Verbindungen.

Die Herstellung und die Verwendung von erfindungsgemäßen Wirkstoffen werden durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

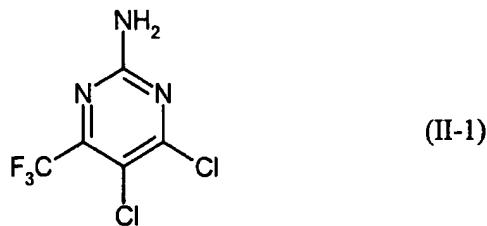
5

Ein Gemisch aus 4,8 g (0,02 mol) 4,5-Dichlor-6-trifluormethyl-2-amino-pyrimidin in 80 ml Dioxan wird bei Raumtemperatur mit 2,8 g (0,022 mol) N,N-Diisopropyl-ethylamin und 3,03 g (0,022 mol) 3-Phenyl-1-propylamin versetzt und dann 18 Stunden unter Rühren auf 60°C erhitzt. Danach fügt man noch 0,3 g N,N-Diisopropyl-ethylamin und 0,3 g 3-Phenyl-1-propylamin hinzu und erhitzt weitere 8 Stunden unter Rühren auf 80°C. Anschließend wird das Reaktionsgemisch unter verminderterem Druck eingeengt und mit Wasser sowie mit einer geringen Menge an Salzsäure versetzt. Der anfallende Niederschlag wird abgesaugt, mit Wasser gewaschen und nach dem Trocknen in Diethylether gelöst. Diese Lösung wird über Kieselgel abgesaugt, und das Filtrat wird unter verminderterem Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 4 g (60 % der Theorie) an 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(3-phenyl-1-propylamino)-pyrimidin in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 106°C.

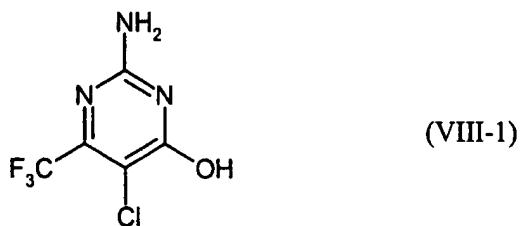
10

15

20

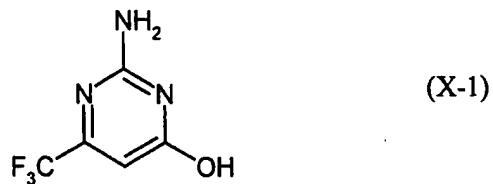
Herstellung von Ausgangssubstanzen

16,3 g (0,076 mol) 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-hydroxy-pyrimidin werden bei Raumtemperatur unter Rühren und unter Kühlung mit 78 ml Phosphoroxychlorid und 22 ml N,N-Diethyl-anilin versetzt. Nach beendeter Zugabe wird das Reaktionsgemisch 1,5 Stunden unter Rühren auf 90°C erhitzt. Anschließend wird unter vermindertem Druck auf ein Drittel des ursprünglichen Volumens eingeengt. Das verbleibende Gemisch wird langsam in kaltes Wasser eingerührt. Der anfallende Feststoff wird abgesaugt, nacheinander einmal mit Wasser und einmal mit n-Hexan gewaschen und dann getrocknet. Man erhält auf diese Weise 13,9 g (78,8 % der Theorie) an 4,5-Dichlor-6-trifluormethyl-2-aminopyrimidin in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 105°C.



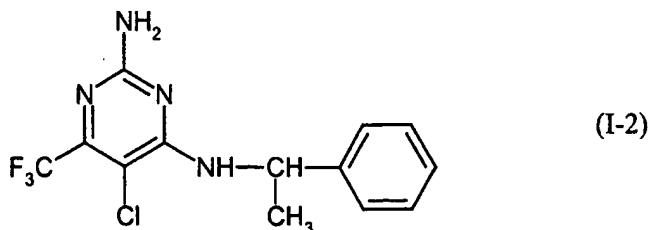
In ein Gemisch aus 11 g (0,06 mol) 6-Trifluormethyl-2-amino-4-hydroxy-pyrimidin und 45 ml Essigsäure werden unter Rühren bei Raumtemperatur und unter Kühlung 15 4,2 g (0,06 mol) Chlorgas so eingeleitet, daß die Temperatur des Reaktionsgemisches 30°C nicht übersteigt. Nach beendeter Zugabe wird noch 2 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch in Wasser gegeben und durch Hinzufügen von wäßrigem Ammoniak alkalisch gestellt. Der dabei anfallende Feststoff wird abgesaugt und getrocknet. Das Filtrat wird dreimal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Auf diese Weise erhält man insgesamt 20 5,2 g (40 % der Theorie) an 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-hydroxypyrimidin in Form einer Festsubstanz mit einem Schmelzpunkt oberhalb von 260°C.

- 54 -



Zu 320 ml n-Butanol werden bei Raumtemperatur unter Kühlen und unter Argonatmosphäre zunächst 92 g (0,8 mol) Kalium-tert.-butylat und dann 38,2 g (0,4 mol) Guanidin-Hydrochlorid unter Rühren hinzugefügt. Danach lässt man das Gemisch bei einer Badtemperatur von 120°C 15 Minuten unter Rückfluß sieden, kühlt dann auf 60°C ab und tropft 73,6 g (0,4 mol) Ethyl-4,4,4-trifluoracetacetat schnell hinzu. Anschließend wird das Reaktionsgemisch 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt und dann auf Raumtemperatur abgekühlt. Der anfallende Niederschlag wird abgesaugt und mit 25 ml n-Butanol nachgewaschen. Das Filtrat wird durch Zugabe von Essigsäure auf pH 5 eingestellt. Der dabei anfallende Feststoff wird abgesaugt, einmal mit n-Hexan verrührt und erneut abgesaugt. Das Festprodukt wird mit kaltem Wasser verrührt, wiederum abgesaugt und getrocknet, wobei man unter verminderter Druck bei einer Badtemperatur von 60°C arbeitet. Man erhält auf diese Weise 35 g (49 % der Theorie) an 6-Trifluormethyl-2-amino-4-hydroxypyrimidin in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 282°C.

Beispiel 2



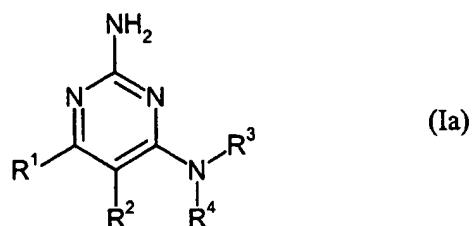
20

Ein Gemisch aus 1,2g (0,005 mol) 4,5-Dichlor-6-trifluormethyl-2-amino-pyrimidin, 15 ml Dioxan und 0,5 g (0,005 mol) Triethylamin wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit einer Lösung von 0,62 g (0,005 mol) 1-Phenyl-ethylamin in 1 ml Dioxan versetzt. Das Reaktionsgemisch wird 18 Stunden bei 95°C gerührt, dann mit 0,62 g

(0,005 ml) 1-Phenyl-ethylamin versetzt und 5 Stunden bei 95°C gerührt. Nach weiterer Zugabe von 1 g (0,01 mol) Triethylamin und 0,62 g (0,005 mol) 1-Phenyl-ethylamin wird noch 64 Stunden bei 95°C gerührt und dann unter verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mehrmals mit Wasser gewaschen, dann mit 5 Cyclohexan verrührt und abgesaugt. Das verbleibende Produkt wird mit Cyclohexan : Aceton = 8:2 als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates unter verminderter Druck erhält man 0,85 g (54 % der Theorie) an 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-(1-phenyl-1-ethylamino)-pyrimidin in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 118°C.

10

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 1 aufgeführten Stoffe der Formel



15 hergestellt.

Tabelle 1

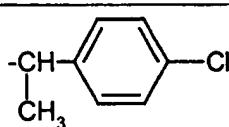
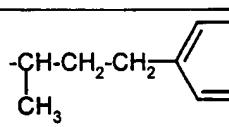
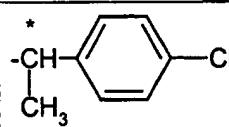
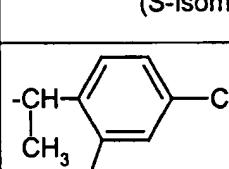
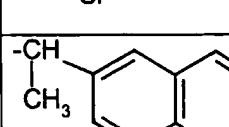
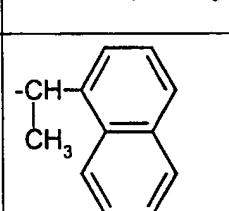
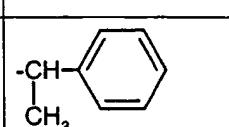
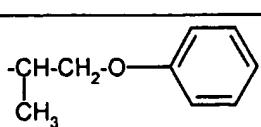
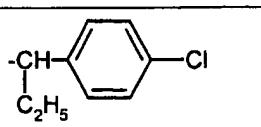
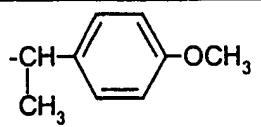
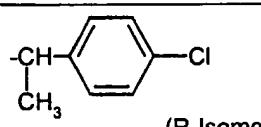
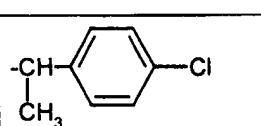
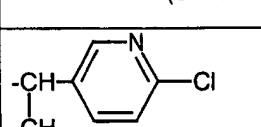
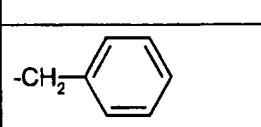
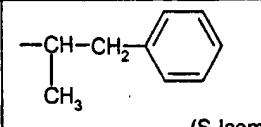
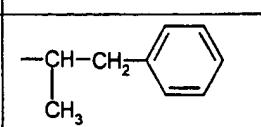
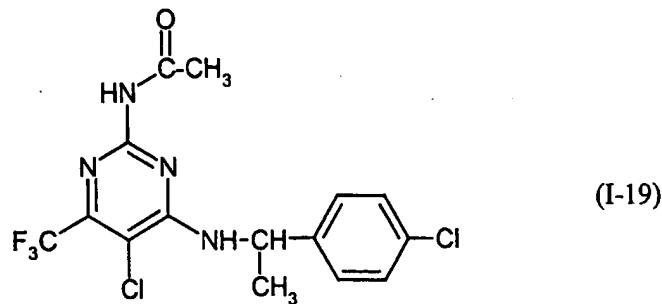
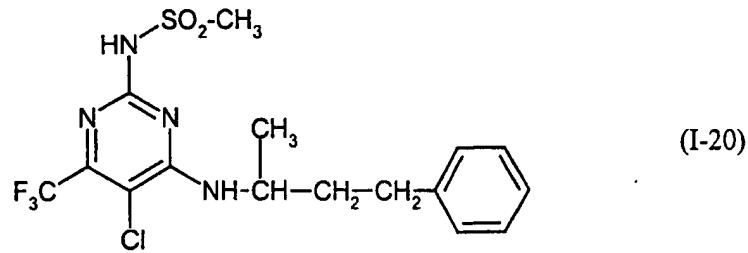
Bsp. Nr.	Verb. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Physikalische Konstante
3	I-3	-CF ₃	Cl	H		Fp. 144°C
4	I-4	-CF ₃	Cl	H		Fp. 98°C
5	I-5	-CF ₃	Cl	H	 (S-Isomer)	log p = 3,24
6	I-6	-CF ₃	Cl	H		Fp. 144°C
7	I-7	-CF ₃	Cl	H		Fp. 126°C
8	I-8	-CF ₃	Cl	H		Fp. 145°C
9	I-9	-CF ₃	Cl	H	 (R-Isomer)	log p = 3,24

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	Verb. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Physikalische Konstante
10	I-10	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,55
11	I-11	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,97
12	I-12	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,35
13	I-13	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,63
14	I-14	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,63
15	I-15	-CF ₃	Cl	H		log p = 2,87
16	I-16	-CF ₃	Cl	H		log p = 2,67
17	I-17	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,54
18	I-18	-CF ₃	Cl	H		log p = 3,54

Beispiel 19

Ein Gemisch aus 1,23 g (0,0035 mol) 5-Chlor-6-trifluormethyl-2-amino-4-[1-(4-chlor-phenyl)-1-ethyl-amino]-pyrimidin, 25 ml Methylenchlorid, 0,82 g (0,0104 mol) Pyridin und 0,22 g (0,0018 mol) Dimethylamino-pyridin wird bei 0°C unter Rühren mit 0,32 g (0,0039 mol) Acetylchlorid versetzt. Nach beendeter Zugabe wird das Reaktionsgemisch 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend fügt man noch 0,08 g Pyridin, 0,02 g Dimethylamino-pyridin und 0,03 g Acetylchlorid hinzu und röhrt weitere 6 Stunden bei Raumtemperatur. Das Reaktionsgemisch wird dann mit Wasser versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit leicht angesäuertem Wasser (pH 4) gewaschen, getrocknet und unter verminderterem Druck eingeengt. Der Rückstand wird in Toluol aufgenommen. Das entstehende Gemisch wird filtriert und unter verminderterem Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 0,9 g (65 % der Theorie) an der Verbindung der oben angegebenen Struktur in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 127°C.

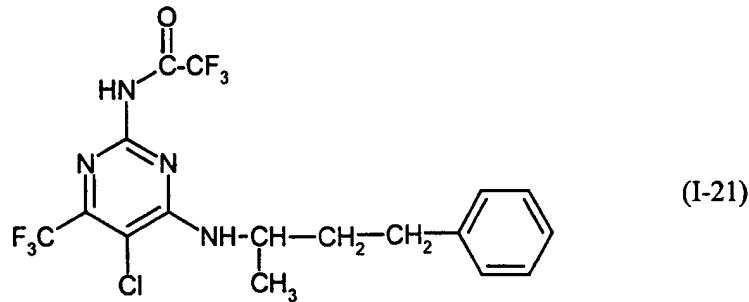
Beispiel 20

20

Ein Gemisch aus 1,5 g (0,0048 mol) 6-Trifluormethyl-2-amino-4-(3-phenyl-1-methyl-prop-1-yl-amino)-pyrimidin und 4 g (0,0061 mol) Pyridin wird bei Raum-

temperatur mit 0,7 g (0,0061 mol) Methansulfonsäurechlorid versetzt und dann 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend engt man unter verminderter Druck ein, löst den verbleibenden Rückstand in Essigsäureethylester, wäscht die Lösung mit leicht angesäuertem Wasser (pH 4), trocknet und engt unter verminderter Druck ein. Der verbleibende Rückstand wird mit n-Hexan:Aceton = 8:2 an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates erhält man 0,7 g (37 % der Theorie) an der Verbindung der oben angegebenen Formel in Form eines Öles mit einem log P-Wert von 3,36.

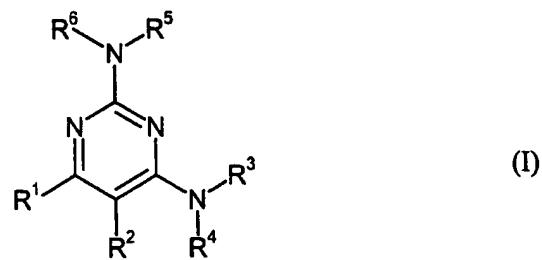
10 **Beispiel 21**



Ein Gemisch aus 0,75 g (0,0022 mol) 6-Trifluormethyl-5-chlor-2-amino-4-(3-phenyl-1-methyl-prop-1-yl-amino)-pyrimidin, 0,85 g (0,0085 mol) Triethylamin und 15 ml 15 Acetonitril wird bei 0°C unter Rühren portionsweise mit 0,5 g (0,0024 mol) Trifluoressigsäureanhydrid versetzt. Nach beendeter Zugabe röhrt man 18 Stunden bei Raumtemperatur, versetzt dann mit 0,05 g Trifluoressigsäureanhydrid und 0,085 g Triethylamin und röhrt weitere 6 Stunden bei Raumtemperatur. Anschließend wird noch einmal mit 0,085 g Triethylamin und 0,05 g Trifluoressigsäureanhydrid versetzt 20 und noch eine Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch unter verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Wasser versetzt und mehrfach mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 0,8 g (92 % der Theorie) an der Verbindung der oben 25 angegebenen Struktur in Form eines Öles mit einem log P-Wert von 4,74.

- 60 -

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 2 aufgeführten Stoffe der Formel



5

hergestellt.

Tabelle 2

Bsp. Nr.	Verb. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikalische Konstante log p = 3,59
22	I-22	-CF ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	-SO ₂ -CH ₃	
23	I-23	-CF ₃	H	H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	-SO ₂ -CH ₃	*
24	I-24	-CF ₃	H	H	-CH ₂ C ₆ H ₅	H	-SO ₂ -CH ₃	Fp. 123°C
25	I-25	-CF ₃	H	H	-CH ₂ C ₆ H ₅	H	-SO ₂ -CH ₃	Fp. 116°C (Zers.)
26	I-26	-CF ₃	H	H	-CH ₂ C ₆ H ₅	H	-C(=O)CF ₃	log p = 4,01

Tabelle 2 (Fortsetzung)

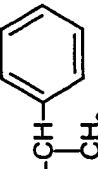
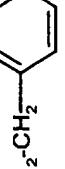
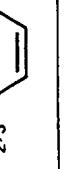
Bsp. Nr.	Verb. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikalische Konstante
27	I-27	-CF ₃	Cl	H		H		Fp. 95°C
28	I-28	-CF ₃	Cl	H		H		log p = 4,05
29	I-29	-CF ₃	Cl	H		H		Fp. 62-65°C
30	I-30	-CF ₃	Cl	H		H		log p = 3,89

Tabelle 2 (Fortsetzung)

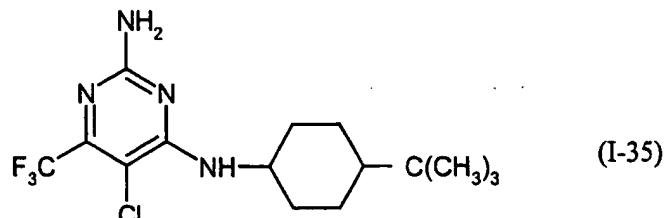
Bsp. Nr.	Verb. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Physikalische Konstante
31	I-31	-CF ₃	H	H	-CH ₂ -C ₆ H ₄ -Cl	H	-C(=O)-CF ₃	log p = 4,00
32	I-32	-CF ₃	Cl	H	-CH ₂ -C ₆ H ₄	H	-C(=O)-CF ₃	log p = 4,18
33	I-33	-CF ₃	Cl	H	-CH ₂ -C ₆ H ₄ -Cl	H	-C(=O)-CF ₃	log p = 4,59
34	I-34	-CF ₃	Cl	H	-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	-C(=O)-CF ₃	log p = 4,43

*) Die Substanz zeigt im ¹H-NMR-Spektrum (d₆-DMSO) für die Gruppe -NH-SO₂CH₃ ein Signal bei 11,12 ppm

- 64 -

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in den folgenden Beispielen aufgeführten Stoffe hergestellt.

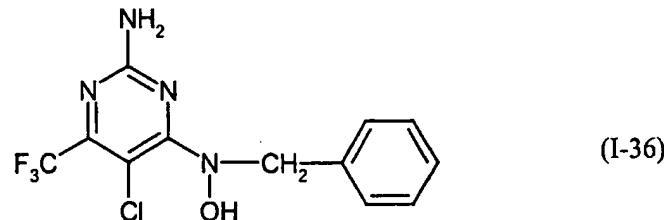
Beispiel 35



5

Schmelzpunkt: 149°C

Beispiel 36



10

Schmelzpunkt: 139-141°C

Verwendungsbeispiele**Beispiel A****5 Erysiphe-Test (Weizen) / protektiv**

Lösungsmittel: 25 Gew.-Teile N,N-Dimethylacetamid

Emulgator: 0,6 Gew.-Teile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge.

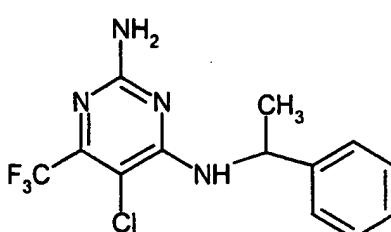
Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit Sporen von Erysiphe graminis f.sp. tritici bestäubt.

20 Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Mehltaupusteln zu begünstigen.

25 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A**Erysiphe-Test (Weizen) / protektiv**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß</u>  (I-2)	250	81

Beispiel B**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

5 Lösungsmittel: 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

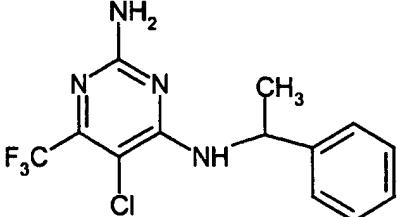
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von *Puccinia recondita* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20 Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

25 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß</u>  (I-2)	250	73

Beispiel C**Leptosphaeria nodorum-Test (Weizen) / kurativ**

5 Lösungsmittel: 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

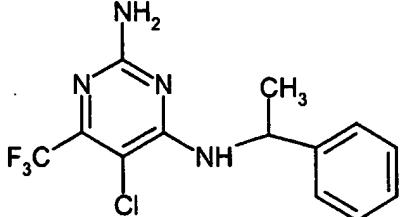
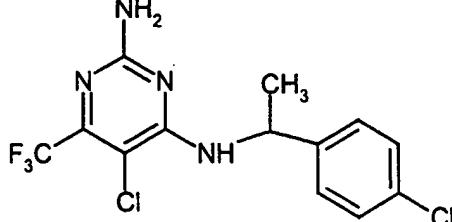
15 Zur Prüfung auf kurative Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit einer Konidien-Suspension von Leptosphaeria nodorum besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine und werden dann mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht.

20 Die Pflanzen werden im Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 15°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

25 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C**Leptosphaeria nodorum-Test (Weizen) / kurativ**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß:</u>  (I-2)	250	79
 (I-3)	250	100

Beispiel D**Post-emergence-Test**

5 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 bis 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

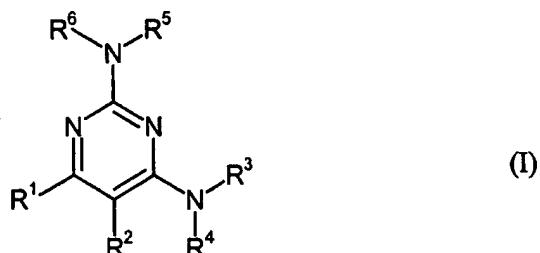
25 Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle D
Post emergence/Gewächshaus

Wirkstoff	Aufwand- menge g ai/ha	Gerste	Weizen	Mais	Digitaria	Amaranthus	Chenopodium	Polygonum	Stellaria	Veronica	Viola
<chem>CC(F)(F)c1nc(NC(=O)C(F)(F)F)c(Cl)c(Cl)c1</chem> (I-31)	500	10	10	15	70	95	90	90	90	95	95
<chem>CC(F)(F)c1nc(NC(=O)C(F)(F)F)c(Cl)c(Cl)c1</chem> (I-26)	250	0	0	0	90	100	100	100	100	95	95

Patentansprüche

1. 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



5

in welcher

10 R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Amino-carbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

R² für Halogen, Cyano oder Nitro steht,

15 R³ für Wasserstoff, Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

20 R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substi-
tuiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, gegebenenfalls
substituiertes Aryloxyalkyl, gegebenenfalls substituiertes Heteroaryl
oder gegebenenfalls substituiertes Heteroarylalkyl steht, und

25 R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylamino-carbonyl oder Trifluormethylcarbonyl stehen oder

R^5 und R^6 gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für eine $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2$ -Gruppe stehen

5 oder

10 R^1 für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Aminocarbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

15 R^2 für Wasserstoff steht,

20 R^3 für Wasserstoff, Alkyl, Hydroxy, Alkoxy, Amino, Alkylamino, Dialkylamino, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Alkyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

25 R^4 für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryloxyalkyl, gegebenenfalls substituiertes Heteroaryl oder gegebenenfalls substituiertes Heteroarylalkyl steht,

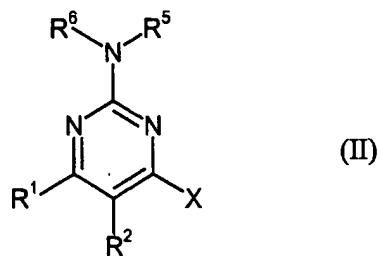
R^5 für Wasserstoff steht und

R^6 für Methylsulfonyl oder Trifluormethylcarbonyl steht,

 sowie deren Säureadditions-Salze und Metallsalz-Komplexe.

2. Verfahren zur Herstellung von 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivaten der Formel (I) gemäß Anspruch 1 sowie von deren Säureadditions-Salzen und Metallsalz-Komplexen, dadurch gekennzeichnet, daß man

5 a) 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel



in welcher

10 R^1, R^2, R^5 und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X für Chlor oder Brom steht,

15 mit Aminen der Formel



in welcher

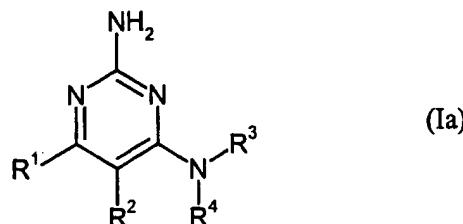
20 R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

25 oder

- 76 -

b) 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel

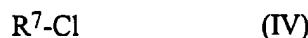


5 in welcher

R¹, R², R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

entweder

10 a) mit Halogen-Verbindungen der Formel



in welcher

15 R⁷ für Alkyl, Acetyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfonyl oder Alkoxy carbonyl steht,20 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

25 b) mit Säureanhydriden der Formel

- 77 -



in welcher

5 R^8 für Methyl oder Trifluormethyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels um-
setzt,

10 oder

γ) mit Isocyanaten der Formel



in welcher

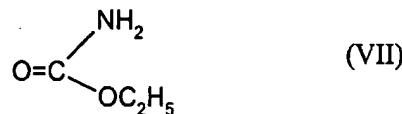
15 R^9 für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels um-
20 setzt,

oder

δ) mit Carbaminsäure-ethylester der Formel

25



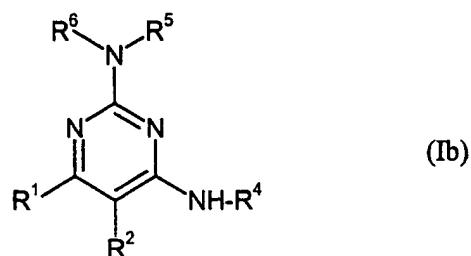
- 78 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

5

c) 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

10

$\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^4, \text{R}^5$ und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

entweder

15

a) mit Halogen-Verbindungen der Formel



in welcher

20

R^7 für Alkyl, Acetyl, Trifluormethylcarbonyl, Methylsulfonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

25

oder

β) mit Säureanhydriden der Formel



5 in welcher

R^8 für Methyl oder Trifluormethyl steht,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels um-
setzt,

oder

15 γ) mit Isocyanaten der Formel



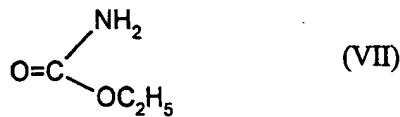
in welcher

20 R^9 für Alkyl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels um-
setzt,

25 oder

δ) mit Carbaminsäure-ethylester der Formel



gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5

und gegebenenfalls anschließend an die Verbindungen der Formel (I) eine Säure oder ein Metallsalz addiert.

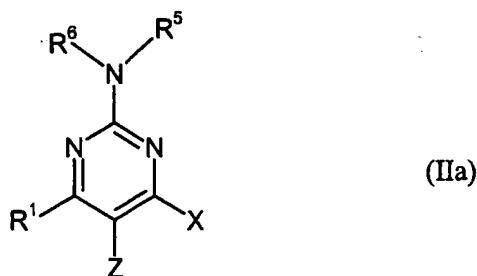
3. Mikrobizide und herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivat der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz oder Metallsalz-Komplex eines 2,4-Diaminopyrimidin-Derivates der Formel (I) neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

15 4. Verwendung von 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivaten der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. von deren Säureadditions-Salzen und Metallsalz-Komplexen als Mikrobizide und Herbizide.

20 5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze oder Metallsalz-Komplexe auf die Mikroorganismen bzw. Unkräuter und/oder deren Lebensraum aus bringt.

25 6. Verfahren zur Herstellung von mikrobiziden und herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man 2,4-Diamino-pyrimidin-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze oder Metallsalz-Komplexe mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

7. 4-Halogen-2-amino-pyrimidine der Formel



in welcher

5

R^1 für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Amino-carbonyl oder Alkoxy-carbonyl steht,

10

R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, Alkylamino-carbonyl oder Trifluormethylcarbonyl stehen oder

15

R^5 und R^6 gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für eine $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2$ -Gruppe stehen,

X für Chlor oder Brom steht und

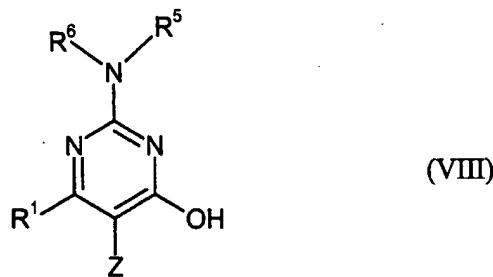
20

Z für Chlor oder Brom steht.

8. Verfahren zur Herstellung von 4-Halogen-2-amino-pyrimidinen der Formel (IIa) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß man

25

d) 4-Hydroxy-pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

R^1 , R^5 , R^6 und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

mit Phosphoroxy-halogeniden der Formel



10

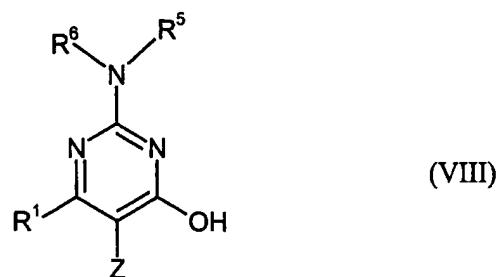
in welcher

X die oben angegebene Bedeutung hat,

15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und
gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

9. 4-Hydroxypyrimidin-Derivate der Formel



20

in welcher

5 R¹ für Trifluormethyl, Difluormethyl, Chlor-difluor-methyl, Methyl, Methoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Cyano, Chlor, Brom, Carboxyl, Amino-carbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

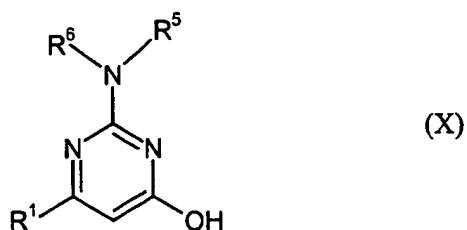
10 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Methylsulfonyl, Acetyl, Carboxyl, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylamino-carbonyl oder Trifluormethylcarbonyl stehen oder

15 R⁵ und R⁶ gemeinsam für eine Alkylenkette mit 4 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für eine -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-Gruppe stehen und

20 Z für Chlor oder Brom steht.

10. Verfahren zur Herstellung von 4-Hydroxy-pyrimidin-Derivaten der Formel (VIII) gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß man

25 e) Pyrimidin-Derivate der Formel



in welcher

25 R¹, R⁵ und R⁶ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 84 -

mit Chlor oder Brom, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.